## ⑲ 日本 国特許庁(JP)

①特許出願公開

# @ 公 開 特 許 公 報 (A) 平4-139182

**図発明の名称** エボキシスクシナム酸誘導体およびその中間体

②特 顋 平2-261657

個発 四月 奢 男 Ħ B 充 東京都豊島区高田3丁目24番1号 大正製菜株式会社内 回発 明 零 角 谷 重 泰 東京都豊島区高田3丁目24番1号 大正製菜株式会社内 個発 尾 明 7-邪 沓 東京都登島区高田3丁目24番1号 大正製薬株式会社内 ⑫発 劽 Щ 胳 男 東京都受島区高田3丁目24番1号 大正製薬株式会社内 创出 颐 大正製案株式会社 東京都豊島区高田3丁目24番1号 個代 理 弁理士 北川 宫盗

### 94 EE =

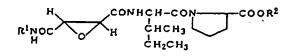
# 1. 発明の名称

エポキシスクシナム 数財 導体 および その中間休

# 2. 特許国来の範囲 (1) 式 CONHCH-CON CHCH3 H CHCH3 CHSCH

(式中、R 1 は炭素菓子致 1 ~ 1 0 のアルキルを、フェニル基またはベンジル基を示す。)で表わされるエポキシスクシナム政務導体およびその事学的に許容できる場。

### (1) 式



(式中、RIは炭素原子数 I ~ I O のアルキル基、フェニル基またはペンジル基を示し、R<sup>2</sup>はカルボ キシル基の保証基を示す。)で表わされるエポキ シスクシナム放民事体。

### 3. 発明の詳細な説明

### <u> 戻業上の利用分野</u>

本発明は医筋として有用なエポキシスクシナム 散誘導体に関し、更に抑しくはカテブシン 8 を特 ぬ的に阻否するエポキシスクシナム酸原導体およ びその製造中間体に関する。

### 従来の技術

システインプロテアーゼに属するカルシウム依存性中性プロテアーゼ(CANP)、カテプシン 8、カテプシンしなどは、難病である筋ジストロフィー症やジスタールミオバチーなどの筋が壊疾 悪において筋構造蛋白の分解に関与していると言われている。

従来、数理のシステインプロテアーゼの活性を 強奮する化合物として、N-(L-3-トランス-

